

## 特許協力条約

WIPO

PCT

PCT

## 特許性に関する国際予備報告（特許協力条約第二章）

(法第12条、法施行規則第56条)  
[PCT36条及びPCT規則70]

出願人又は代理人 の書類記号 WA-0902	今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JP2004/003324	国際出願日 (日.月.年) 12.03.2004	優先日 (日.月.年) 14.03.2003
国際特許分類 (I.P.C) Int. Cl' C07D309/10, 405/04, 405/10, 407/04, 407/10, 409/04, 409/10, 409/14, 413/10, 417/10, 495/04, A61K31/351, 31/381, 31/4035, 31/404, 31/41, 31/4184, 31/423, 31/428, 31/4433, <補充欄に続く>		
出願人（氏名又は名称） 山之内製薬株式会社		

1. この報告書は、PCT35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。  
法施行規則第57条（PCT36条）の規定に従い送付する。

2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 6 ページからなる。

3. この報告には次の附属物件も添付されている。

a  附属書類は全部で 2 ページである。

换正されて、この報告の基礎とされた及び／又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び／又は図面の用紙（PCT規則70.16及び実施細則第607号参照）

第I欄4. 及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた換正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙

b  電子媒体は全部で \_\_\_\_\_ (電子媒体の種類、数を示す)。  
配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。（実施細則第802号参照）

4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。

第I欄 国際予備審査報告の基礎  
 第II欄 優先権  
 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成  
 第IV欄 発明の単一性の欠如  
 第V欄 PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明  
 第VI欄 ある種の引用文献  
 第VII欄 国際出願の不備  
 第VIII欄 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 26.08.2004	国際予備審査報告を作成した日 03.03.2005
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官（権限のある職員） 安藤 倫世 電話番号 03-3581-1101 内線 3492 4P 9837

## 第I欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

この報告は、\_\_\_\_\_語による翻訳文を基礎とした。

それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。

PCT規則12.3及び23.1(b)にいう国際調査

PCT規則12.4にいう国際公開

PCT規則55.2又は55.3にいう国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。（法第6条（PCT14条）の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。）

出願時の国際出願書類

明細書

第 1-92 ページ、出願時に提出されたもの  
第 \_\_\_\_\_ ページ\*、\_\_\_\_\_ 付けで国際予備審査機関が受理したもの  
第 \_\_\_\_\_ ページ\*、\_\_\_\_\_ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

請求の範囲

第 3-11 項、出願時に提出されたもの  
第 \_\_\_\_\_ 項\*、PCT19条の規定に基づき補正されたもの  
第 1, 2 項\*、26.08.2004 付けで国際予備審査機関が受理したもの  
第 \_\_\_\_\_ 項\*、\_\_\_\_\_ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

図面

第 \_\_\_\_\_ ページ/図、出願時に提出されたもの  
第 \_\_\_\_\_ ページ/図\*、\_\_\_\_\_ 付けで国際予備審査機関が受理したもの  
第 \_\_\_\_\_ ページ/図\*、\_\_\_\_\_ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3.  指定により、下記の書類が削除された。

<input type="checkbox"/> 明細書	第 _____	ページ
<input type="checkbox"/> 請求の範囲	第 _____	項
<input type="checkbox"/> 図面	第 _____	ページ/図
<input type="checkbox"/> 配列表（具体的に記載すること）	_____	
<input type="checkbox"/> 配列表に関するテーブル（具体的に記載すること）	_____	

4.  この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。（PCT規則70.2(c)）

<input type="checkbox"/> 明細書	第 _____	ページ
<input type="checkbox"/> 請求の範囲	第 _____	項
<input type="checkbox"/> 図面	第 _____	ページ/図
<input type="checkbox"/> 配列表（具体的に記載すること）	_____	
<input type="checkbox"/> 配列表に関するテーブル（具体的に記載すること）	_____	

\* 4. に該当する場合、その用紙に "superseded" と記入されることがある。

## 第三欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解の不作成

1. 次に関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

 国際出願全体 請求の範囲 12

理由:

この国際出願又は請求の範囲 12 は、国際予備審査をすることを要しない次の事項を内容としている（具体的に記載すること）。

請求の範囲 12 は、治療による人体の処置方法に関するものであって、この国際調査機関が国際予備審査をすることを要しない対象に係るものである。

明細書、請求の範囲若しくは図面（次に示す部分）又は請求の範囲 12 の記載が、不明確であるため、見解を示すことができない（具体的に記載すること）。

全部の請求の範囲又は請求の範囲 12 が、明細書による十分な裏付けを欠くため、見解を示すことができない。

請求の範囲 12 について、国際調査報告が作成されていない。

ヌクレオチド又はアミノ酸の配列表が、実施細則の附属書C（塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のためのガイドライン）に定める基準を、次の点で満たしていない。

書面による配列表が

提出されていない。  
 所定の基準を満たしていない。  
 提出されていない。  
 所定の基準を満たしていない。

コンピュータ読み取り可能な形式による配列表が

コンピュータ読み取り可能な形式によるヌクレオチド又はアミノ酸の配列表に関連するテーブルが、実施細則の附属書Cの2に定める技術的な要件を、次の点で満たしていない。

提出されていない。  
 所定の技術的な要件を満たしていない。

詳細については補充欄を参照すること。

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条（PCT35条(2)）に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

## 1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲 請求の範囲	1-11	有無
進歩性 (I S)	請求の範囲 請求の範囲	4-7 1-3, 8-11	有無
産業上の利用可能性 (I A)	請求の範囲 請求の範囲	1-11	有無

## 2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

文献 1. TODOULOU, O. G. et al., Synthesis and antiviral activity of some new 1H-1, 2, 4-triazole derivatives, European Journal of Medicinal Chemistry, 1994, Vol. 29, pp. 611-620

文献 2. WO 98/31697 A1

文献 3. BUCHANAN, J. Grant et al., Synthesis of C-glycosyltetrazoles related to 3-deoxy-D-arabino-heptulosonic acid 7-phosphate (DAHP); potential inhibitors of early steps in the shikimate pathway, Journal of the Chemical Society, Perkin Transactions 1, 1992, No. 20, pp. 2593-2601

文献 4. JP 6-199695 A

文献 5. VARMA, Shambhu D. et al., Inhibition of lens aldose reductase by flavonoids-their possible role in the prevention of diabetic cataracts, Biochemical Pharmacology, 1976, Vol. 25, No. 22, pp. 2505-2513

文献 6. ANDRADE-CETTO, Adolfo et al., Hypoglycemic effect of Cecropia obtusifolia on streptozotocin diabetic rats, Journal of Ethnopharmacology, 2001, Vol. 78, pp. 145-149

文献 7. SHEN, Zhufang et al., Hypoglycemic effect of the combined use of puerarin and aspirin in mice, Yaoxue Xuebao, 1985, Vol. 20, No. 11, pp. 863-865

請求の範囲 1, 8は、国際調査報告に引用された文献 1-7 から、進歩性を有しない。特に、文献 1 の化合物 6a-j に記載されたトリアゾール環化合物と、文献 3 の化合物 1-9 に記載されたテトラゾール環化合物から、これらにかえて、ジアゾール、ピラゾール等の環を有する化合物を想到することは、当業者にとって容易である。また、文献 2 の全文、文献 4 の特許請求の範囲、文献 5 の第 2507 頁、文献 6 の化合物 2、文献 7 の全文には、請求の範囲 1 に記載の一般式 (I) で示される C-グリコシド誘導体に類似の化合物が記載されているし、文献 1-7 の全文には該 C-グリコシド誘導体が医薬として用いられることも記載されている。

請求の範囲 2 及び 3 は、国際調査報告に引用された文献 1-3 から、進歩性を有しない。特に、文献 1 の化合物 6a-j、文献 3 の化合物 1-9 から、A 環がトリアゾール又はテトラゾール以外の N, S から選択されるヘテロ原子を 1~4 個有する 5 若しくは 6 員單環ヘテロアリール環を想到し得ることは上記の通りである。また、文献 2 の第 17-19 頁には、A 環をベンゼン、インデン、N, S, O から選択されるヘテロ原子を 1-3 個有する 5-14 員ヘテロアリール環となし得ること、B 環をペニドロナフタレン等の炭素数 1-10 のシクロアルキルとなし得ることも記載されている。

## 第VI欄 ある種の引用文献

## 1. ある種の公表された文書 (PCT規則70.10)

出願番号 特許番号	公知日 (日.月.年)	出願日 (日.月.年)	優先日 (有効な優先権の主張) (日.月.年)
WO 2004/013118 A1 [EX]	12.02.2004	04.08.2003	05.08.2002
WO 03/087093 A1 [EX]	23.10.2003	08.04.2002	
WO 03/094928 A1 [EX]	20.11.2003	28.04.2003	06.05.2002
WO 03/082887 A1 [EX]	09.10.2003	28.03.2002	
US 6617313 B1 [EX]	09.09.2003	13.05.2002	

## 2. 書面による開示以外の開示 (PCT規則70.9)

書面による開示以外の開示の種類	書面による開示以外の開示の日付 (日.月.年)	書面による開示以外の開示に言及している 書面の日付 (日.月.年)

## 補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

第 欄の続き

<国際特許分類 (IPC) の続き>

Int. Cl' A61K31/497, 31/5377, A61P3/10, 3/04

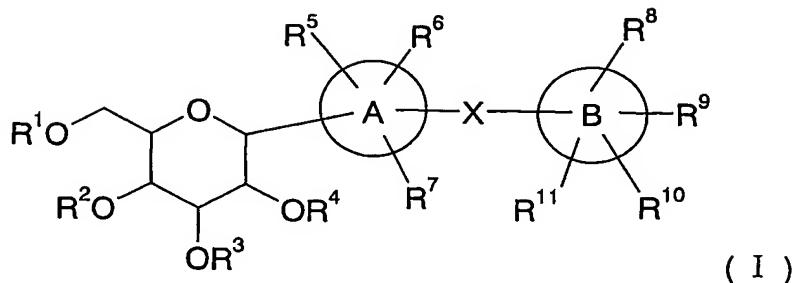
<第V. 2欄の続き>

請求の範囲 9－11は、国際調査報告に引用された文献1－7から、進歩性を有しない。文献2の第46頁、文献4の特許請求の範囲、文献5－7の全文には、C-グリコシド誘導体が糖尿病の治療に用いられることが記載されている。請求の範囲9, 11は、Na<sup>+</sup>-グルコース共輸送体阻害剤に関するものであるが、Na<sup>+</sup>-グルコース共輸送体阻害剤とは糖尿病治療剤を包含するものであるから、文献2, 4－7に記載された薬効を、類似の化合物において確認してみると当業者にとって容易である。

請求の範囲4－7は、国際調査報告に引用された何れの文献にも記載も示唆もされていないから、新規性・進歩性を有する。特に、A環がベンゼン環であり、B環が飽和若しくは不飽和のN, S, Oから選択されるヘテロ原子を1～4個有する8～10員2環ヘテロ環であり、さらに、該B環がベンゼン環を含むものである場合は、XはB環に含まれるベンゼン環以外の部分でB環と結合するものである化合物は、記載も示唆もされていない。

## 請求の範囲

1. (補正後) 下記一般式 (I) で示されるC-グリコシド誘導体又はその塩  
:



(上記式 (I) 中の記号は、それぞれ以下の意味を有する。

A環：(1) ベンゼン環、(2) N、S、Oから選択されるヘテロ原子を1～4個有する5若しくは6員單環ヘテロアリール環であって、トリアゾール及びテトラゾール以外の5若しくは6員單環ヘテロアリール環、又は(3) 飽和若しくは不飽和のN又はSから選択されるヘテロ原子を1～4個有する8～10員2環ヘテロ環、

B環：(1) 飽和若しくは不飽和のN、S、Oから選択されるヘテロ原子を1～4個有する8～10員2環ヘテロ環、(2) 飽和若しくは不飽和のN、S、Oから選択されるヘテロ原子を1～4個有する5若しくは6員單環ヘテロ環、(3) 不飽和の8若しくは9員2環炭化水素環、又は(4) ベンゼン環、

X：結合、又は低級アルキレン、

(但し、A環、B環及びXの間には、(1) A環がベンゼン環を意味する場合は、B環はベンゼン環以外の環を意味する、(2) A環がベンゼン環を意味し、かつB環がその一部にベンゼン環を含む飽和若しくは不飽和のN、S、Oから選択されるヘテロ原子を1～4個有する8～10員2環ヘテロ環、又は不飽和の8若しくは9員2環炭化水素環を意味する場合は、XはB環に含まれるベンゼン環以外の部分でB環と結合する、との相互関係を有する。)

R<sup>1</sup>～R<sup>4</sup>：同一又は異なって、水素原子、低級アルキル、-C(=O)-低級アルキル、又は-低級アルキレン-アリール、

R<sup>5</sup>～R<sup>11</sup>：同一又は異なって、水素原子、低級アルキル、シクロアルキル、ハロゲン、ハロゲン置換低級アルキル、-OH、=O、-NH<sub>2</sub>、低級アルキルスル

ホニルー、ハロゲン置換低級アルキルスルホニルー、アリールスルホニルー、アリール、飽和若しくは不飽和のN、S、Oから選択されるヘテロ原子を1～4個有する5若しくは6員單環ヘテロ環、-低級アルキレン-OH、-低級アルキレン-O-低級アルキル、-低級アルキレン-O-C(=O)-低級アルキル、-低級アルキレン-O-低級アルキレン-C(=O)-O-低級アルキル、-低級アルキレン-NH<sub>2</sub>、-低級アルキレン-NH-低級アルキル、-低級アルキレン-N(低級アルキル)<sub>2</sub>、-低級アルキレン-NH-C(=O)-低級アルキル、-COOH、-CN、-C(=O)-O-低級アルキル、-C(=O)-NH<sub>2</sub>、-C(=O)-NH-低級アルキル、-C(=O)-N(低級アルキル)<sub>2</sub>、-O-低級アルキル、-O-シクロアルキル、-O-低級アルキレン-OH、-O-低級アルキレン-O-低級アルキル、-O-低級アルキレン-COOH、-O-低級アルキレン-C(=O)-O-低級アルキル、-O-低級アルキレン-C(=O)-NH-低級アルキル、-O-低級アルキレン-C(=O)-N(低級アルキル)<sub>2</sub>、-O-低級アルキレン-CH(OH)-CH<sub>2</sub>(OH)、-O-低級アルキレン-NH<sub>2</sub>、-O-低級アルキレン-NH-低級アルキル、-O-低級アルキレン-N(低級アルキル)<sub>2</sub>、-O-低級アルキレン-NH-C(=O)-低級アルキル、-NH-低級アルキル、-N(低級アルキル)<sub>2</sub>、-NH-SO<sub>2</sub>-低級アルキル、-NH-SO<sub>2</sub>-ハロゲン置換低級アルキル、-NH-低級アルキレン-OH、-NH-C(=O)-低級アルキル、-NH-C(=O)-NH<sub>2</sub>、-NH-C(=O)-NH-低級アルキル、-NH-C(=O)-N(低級アルキル)<sub>2</sub>、又は-NH-C(=O)-O-低級アルキル)。

2. (補正後) 前記式(I)中のA環が(1)ベンゼン環、又は(2)N、S、Oから選択されるヘテロ原子を1～4個有する5若しくは6員單環ヘテロアリール環であって、トリアゾール及びテトラゾール以外の5若しくは6員單環ヘテロアリール環である、請求の範囲第1項に記載のC-グリコシド誘導体又はその塩。

3. 前記式(I)中のB環が(1)飽和若しくは不飽和のN、S、Oから選択されるヘテロ原子を1～4個有する8～10員2環ヘテロ環、又は(2)飽和若しくは不飽和のN、S、Oから選択されるヘテロ原子を1～4個有する5若しく